Рабелок



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рабепразол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоязвенное средство, ингибитор H^+-K^+-АТФ-азы (протонового насоса). Механизм действия связан с угнетением фермента H^+-K^+-АТФ-азы в париетальных клетках желудка, что приводит к блокированию конечной стадии образования соляной кислоты. Это действие является дозозависимым и приводит к угнетению как базальной, так и стимулированной секреции соляной кислоты независимо от природы раздражителя.

Фармакокинетика

После приема внутрь всасывается из ЖКТ. При дозе 20 мг C_{max} достигается через 3.5 ч. Изменения C_{max} и AUC носят линейный характер (в диапазоне доз от 10 до 40 мг). Абсолютная биодоступность составляет около 52% вследствие эффекта "первого прохождения" через печень. Биодоступность рабепразола не увеличивается при многократном приеме.

Прием пищи и время приема в течение суток не влияют на абсорбцию рабепразола.

Связывание с белками плазмы составляет 97%.

Рабепразол натрия подвергается эффекту "первого прохождения". Метаболизируется в печени при участии изоферментов системы CYP.

Основные метаболиты (тиоэфир и карбоновая кислота) и второстепенные метаболиты (сульфон, диметилтиоэфир и конъюгат меркаптопуровой кислоты) присутствуют в низких концентрациях.

У здоровых добровольцев $T_{1/2}$ составляет около 1 ч, общий клиренс - около 283 Примерно 90% выводится с мочой преимущественно в виде двух метаболитов: конъюгата меркаптопуровой кислоты и карбоновой кислоты. В токсикологических исследованиях у лабораторных животных найдены еще 2 неидентифицированных метаболита. Остальная часть выводится с калом.

У пациентов со стабильной терминальной стадией хронической почечной недостаточности, нуждающихся в гемодиализе (КК менее 5 мл/мин/1.73 $м^2$) AUC и C_{max} были на 35% ниже, чем у здоровых добровольцев. В среднем $T_{1/2}$ рабепразола составлял 0.82 ч у здоровых добровольцев, 0.95 ч - у пациентов во время гемодиализа и 3.6 ч - после гемодиализа. При заболеваниях почек клиренс рабепразола у пациентов на гемодиализе был приблизительно в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев.

У пациентов с хронической печеночной недостаточностью слабой или средней степени после однократного приема

рабепразола наблюдалось увеличение C_{max}, $T_{1/2}$, AUC.

В случае замедленного метаболизма CYP2C19 после приема рабепразола по 20 мг/сут в течение 7 дней AUC и $T_{1/2}$ составляли 1.9 и 1.6 соответственно при экстенсивном метаболизме, в то время как C_{max} увеличивалась только на 40%.

У пациентов пожилого возраста выведение рабепразола несколько замедлено.

Показания к применению:

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с Helicobacter pylori (в комбинации с антибиотиками); гастроэзофагеальный рефлюкс.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

Беременность, период лактации (грудное вскармливание), повышенная чувствительность к рабепразолу натрия или замещенным бензимидазолам.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Разовая доза - 10-20 мг. Частота и длительность применения зависят от показаний и схемы лечения.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диарея, тошнота, боли в животе, рвота, метеоризм, запор; редко - сухость во рту, диспепсия, отрыжка; в единичных случаях - анорексия, гастрит, стоматит, повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, астения, головокружение, бессонница; редко - нервозность, сонливость; в единичных случаях - депрессия, нарушения зрения и вкусовых ощущений.

Со стороны дыхательной системы: возможны - ринит, фарингит, кашель; редко - синусит, бронхит.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь; в единичных случаях - зуд.

Прочие: боли в спине, гриппоподобный синдром; редко - миалгия, боль в груди, озноб, судороги икроножных мышц, инфекция мочевыводящих путей, артралгия, лихорадка; в единичных случаях - увеличение массы тела, усиление потоотделения, лейкоцитоз.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Рабепразол противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

В *экспериментальных исследованиях* установлено, что рабепразол в незначительных количествах проникает через плацентарный барьер, однако не отмечено нарушений фертильности или дефектов развития плода; выделяется с молоком лактирующих крыс.

Клинический опыт применения рабепразола у детей отсутствует, поэтому применение не рекомендуется.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с дигоксином возможно повышение (от небольшой до умеренной) концентрации дигоксина в плазме крови.

При одновременном применении с кетоконазолом уменьшается его биодоступность.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом терапии необходимо исключить злокачественные новообразования желудка, т.к. применение рабепразола может маскировать симптомы и отсрочить правильную диагностику.

Пациентам с нарушениями функции печени или почек коррекции дозы не требуется, однако у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени рабепразол рекомендуется применять с осторожностью.

При одновременном применении с рабепразолом следует корректировать дозы кетоконазола и дигоксина.

В *экспериментальных исследованиях* не установлено канцерогенного действия рабепразола, однако при изучении мутагенности были получены неоднозначные результаты. Тесты на клетках лимфомы у мышей были положительными, при этом микроядерный тест in vivo и тест восстановления ДНК in vivo и in vitro были отрицательными.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Пациентам с нарушениями функции печени коррекции дозы не требуется, однако у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени рабепразол рекомендуется применять с осторожностью.

Источник: http://drugs.thead.ru/Rabelok